

СИНТЕЗ И ИЗУЧЕНИЕ СВОЙСТВ АЗОТСОДЕРЖАЩИХ ДИМЕТИЛСИЛИЛОВЫХ ЭФИРОВ ГЛИЦЕРИНА

Бондарев А.Н.⁽¹⁾, Ларченко Е.Ю.⁽²⁾, Хонина Т.Г.⁽²⁾

⁽¹⁾Уральский федеральный университет

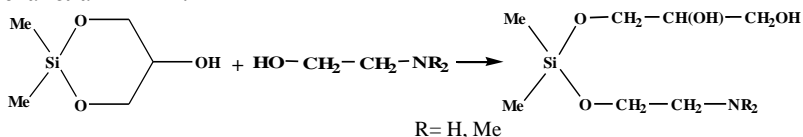
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾Институт органического синтеза УрО РАН

620041, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

Перспективным классом биологически активных кремнийорганических соединений являются производные многоатомных спиртов. Так, циклический диметилглицеролат кремния (2,2-диметил-5-гидрокси-1,3-диокса-2-силациклогексан) [Pat. FR 2160293, 1974] включен во французскую фармакопею; используется местно и системно как противовоспалительное средство, обладающее высокой пенетрирующей активностью в ткани и способствующее проникновению в них лекарственных средств.

Одним из способов модификации глицеролатов кремния с целью повышения фармакологической активности является введение в их структуру фармакофорных азотсодержащих группировок, в частности, этаноламинных.



Нами получены новые модифицированные азотсодержащие глицеролаты кремния из циклического диметилглицеролата и 2-диметиламиноэтанола или 2-аминоэтанола.

Образование модифицированных продуктов доказано методом ЯМР ¹H, при этом в реакции раскрытия цикла наиболее активным является 2-аминоэтанол.

Полученные продукты представляют собой бесцветные прозрачные вязкие жидкости с характерным запахом амина; при попытке перегнать в вакууме выделяется исходный циклический диметилглицеролат кремния и соответствующий амин.

Показано, что наряду с модифицированными азотсодержащими глицеролатами кремния образуются низкомолекулярные продукты полимеризации с концевыми глицерокси- и 2-аминоэтоксигруппами (R=H) или 2-диметиламиноэтоксигруппами (R=Me).

Найдены оптимальные условия, при которых процесс полимеризации сведен к минимуму. Исходя из соотношения величин

относительных интегральных интенсивностей сигналов протонов метильной и метиленовой групп в соответствующих областях химических сдвигов определено количественное соотношение модифицированных глицеролатов кремния, продуктов полимеризации и непрореагировавшего амина.

Проведен комплекс первичных фармакологических исследований на примере продукта взаимодействия циклического диметилглицеролата кремния с 2-диметиламиноэтанолом; показана нетоксичность, выраженное ранозаживляющее, регенерирующее действие и высокая пенетрирующая активность в ткани.

Работа выполнена при финансовой поддержке Президиума РАН (программа № 12-П-3-1030)

СИНТЕЗ АЗОЛИЛАМИНОНИТРОЭТИЛЕНОВ

Борисов С.С., Саватеев К.В., Уломский Е.Н., Русинов В.Л.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Ароматические нитроенамины играют важную роль в качестве ключевых промежуточных продуктов в синтезе разнообразных гетероциклических структур [1]. Из литературных данных известно также, что имидозоламинонитроэтилены обладают противовирусной активностью [2].

В то же время, енамины, содержащие в качестве ароматического фрагмента азолы, никак не представлены в химической литературе, что создает предпосылки к поиску способов синтеза триазилилнитроэтиленов.

Попытки получить целевые продукты взаимодействием аминонитроэтиленов с 3-аминотриазолами при комнатной температуре или при нагревании, в условиях кислотного катализа и без него успехом не увенчались.

Реакцию удалось реализовать при взаимодействии 3-амино-1,2,4-триазолов (1) с нитроацеталем (2) в присутствии п-толуолсульфокислоты. В результате получены триазилилнитроэтилены (3) с выходом 40-45 %. Кислотный катализ необходим для протекания реакции, что, вероятно, свидетельствует о том, что в реакцию вступает не сам нитроацеталь, а продукты его алкоголиза.